

中药药剂学辅导：注射剂的制备 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/17/2021\\_2022\\_\\_E4\\_B8\\_AD\\_E8\\_8D\\_AF\\_E8\\_8D\\_AF\\_E5\\_c23\\_17978.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E4_B8_AD_E8_8D_AF_E8_8D_AF_E5_c23_17978.htm) 一、注射剂制备的工艺流程原辅料的准备与处理、配制、灌封、灭菌、检查和包装。二、中药注射剂原料的准备配制原料的形式：以中药中提取的单体有效成分为原料 以中药中提取的有效部位为原料 中药中提取的总提取物为原料（现状）（一）中药材的预处理 药材原料必须确定品种与来源，鉴定符合要求后，预处理（挑选、洗涤、切制、干燥、粉碎、灭菌）。（二）中药注射用原液的制备 1、要求：最大限度地除去杂质，保留有效成分。2、提取与纯化路线选择依据：（1）根据处方组成中药物所含成分的基本理化性质；（2）结合中医药理论确定的功能主治与现代药理研究；（3）处方的传统用法、剂量；（4）制成注射剂后应用的部位与作用时间。3、用途：可供配制注射剂成品用的原液（或相应的干燥品）。4、制备方法：（1）蒸馏法：本法提取挥发性成分。如：柴胡、野菊花、鱼腥草、艾叶、徐长卿、防风、细辛、大蒜、薄荷、荆芥等均宜用蒸馏法提取有效成分。方法：系指将药材粗粉或薄片放入蒸馏器内，加水适量，待充分吸水膨胀后，加热蒸馏或通水蒸气蒸馏，收集馏出液。若药材中有效成分为挥发油或其他挥发性成分，则可存在于馏出液内。为提高蒸馏效率和防止有效成分被热破坏，也可采用减压蒸馏法。影响蒸馏提取的主要因素：浸泡时间、加水倍量、蒸馏时间。注意：挥发油饱和水溶液澄明度较差时，加少量精制滑石粉或硅藻土吸附滤过，还可加适量增溶剂。蒸馏法制得的

原液，不含或少含电解质，渗透压偏低，直接配制需要加适量的氯化钠调整渗透压。（2）水提醇沉法本法适用于成分即溶于水又溶于醇，利用在水中不溶或乙醇中不同溶解度的特性。方法：处方中药材加水煎煮，提取出有效成分，如：生物碱盐、苷类、有机酸类、氨基酸、多糖类等；同时也提出一些水溶性杂质，如：淀粉、蛋白质、粘液质、鞣质、色素、无机盐等。若往水煎液中加入适量乙醇，可以改变杂质溶解性能而将杂质部分或全部除去。当乙醇浓度达到60%~70%时，除鞣质、树脂等外，其他杂质已基本上沉淀而除去。如果分2~3次加入乙醇，浓度又逐步提高，最终达到75%~80%，则除去杂质的效果更好。药液醇沉时，一般放置12~24小时或24小时以上，若能低温冷藏则更有利于杂质的充分沉淀。水煎液往往还含有一些水不溶性杂质，醇沉也难以除去，应在醇沉、滤过、回收乙醇后，再加水混匀，冷藏24小时，又可除去一些杂质。如此醇、水交替处理，杂质除得完全，有利于提高注射液的澄明度。注意：鞣质、水溶性色素、树脂不能完全除去。（3）醇提水沉法本法适用于成分即溶于醇又溶于水。方法：将中药原料用一定浓度的乙醇用渗漉法、回流法提取，即可提取出生物碱及其盐、苷类、挥发油及有机酸类等；虽然多糖类、蛋白质、淀粉等无效成分不易溶出，但树脂、油脂、色素等杂质却仍可提出。为此，醇提取液经回收乙醇后，再加水处理，并冷藏一定时间，可使杂质沉淀而除去。40%~50%的乙醇可提取强心苷、鞣质、蒽醌及其苷、苦味质等；60%~70%乙醇可提取苷类；更高浓度乙醇则可用于生物碱、挥发油、树脂和叶绿素的提取。注意：鞣质、水溶性色素、树脂不能完全除去。脂溶性色素

较多，溶液颜色较深。（4）双提法 蒸馏法与水醇法的结合。如果处方内药材既需要挥发性成分，又需要不挥发性成分时，可采用“双提法”。双提法是先将药材用蒸馏法提出挥发性成分，再以水提醇沉法或其他方法提取不挥发性成分，最后将两部分合并，供配注射液用。（5）超滤法 中药水煎液中有效成分的分子量多在1000以下，而一般无效成分（鞣质、蛋白质、树脂等）分子量较大，在常温和一定压力下（外源氮气压或真空泵压），将中药提取液通过一种装有高分子多微孔膜的超滤器，可达到去除杂质，保留有效成分的目的。常用的高分子膜有醋酸纤维膜（CA膜）、聚砜膜（PS膜）等。通常选用截留蛋白质分子量为10000~30000的膜孔范围，用于中药注射剂的制备。本法的特点是：以水为溶剂，保持传统的煎煮方法；操作条件温和，不加热，不用有机溶剂，有利于保持原药材的生物活性和有效成分的稳定性；易于除去鞣质等杂质，注射剂的澄明度和稳定性较好。此外，尚有透析法、离子交换法、有机溶剂萃取法、树脂吸附法、酸碱沉淀法、反渗透法、石硫法、离子交换法可供选用。

（三）除去注射剂原液中鞣质的方法：1、鞣质性质：鞣质多元酚的衍生物，中药植物药材中广泛存在，即溶解于水又溶解于醇，有较强的还原性，在酸、酶、强氧化剂存在或加热时，可发生氧化、水解、缩合反应，生成不溶性物质。2、除鞣质目的：一般纯化方法不容易除尽，经灭菌会产生沉淀，影响澄明度，制剂的稳定性差。鞣质与蛋白质形成不溶性鞣酸蛋白，注射时刺激疼痛，往往在注射部位结成硬块。除去鞣质通常用下列几种方法。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)